

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2001-64116

(P2001-64116A)

(43)公開日 平成13年3月13日(2001.3.13)

(51)Int.Cl.
A 61 K 7/00

識別記号

F I
A 61 K 7/00

マークコード*(参考)
N
B
D
J
K

審査請求 未請求 請求項の数5 OL (全12頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2000-240098(P2000-240098)

(22)出願日 平成12年8月8日(2000.8.8)

(31)優先権主張番号 19938756.7

(32)優先日 平成11年8月16日(1999.8.16)

(33)優先権主張国 ドイツ(DE)

(71)出願人 591010376
バイヤースドルフ・アクチエンゲゼルシャ
フト
BEIERSDORF AKTIENGE
SELLSCHAFT
ドイツ連邦共和国デー-20245ハンブル
ク・ウンナシュトラーセ48
(72)発明者 アンヤ・ミュラー
ドイツ23843リュンベル・ビーゼンシュト
ラーセ5
(74)代理人 100060782
弁理士 小田島 平吉

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 水中油型の、低粘性の化粧品又は皮膚科学的調製物

(57)【要約】

【課題】 低粘度を有する化粧用調製物の提供。

【解決手段】 その中に疎水性無機微細顔料が取り入れられた油相；水相；並びにa) 少なくとも1種類の増粘剤及びb) 最大で0.5重量%の1種類以上の乳化剤、の組み合わせ物、を含んでなる、水中油型の、低粘性化粧品又は皮膚科学的調製物。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 1. その中に疎水性無機微細顔料が取り入れられた油相、
2. 水相及び
3. a) 少なくとも1種類の増粘剤及び
b) 最大で0.5重量%の1種類以上の乳化剤の組み合わせ物、を含んでなる水中油型の低粘性の化粧品又は皮膚科学的調製物。

【請求項2】 本調製物の粘性が2000mPa·s未満、なかでも150mPa·s未満(25℃においてHakke粘度計VT-02を使用して測定可能)であることを特徴とする、請求項1記載の調製物。

【請求項3】 増粘剤もしくは増粘剤類が、アクリル酸のポリマー、アクリレート/アクリル酸アルキルコポリマー、アクリル酸C_{10~30}-アルキル/アクリレートコポリマー及びキサンタンゴムの群から選択されることを特徴とする、請求項1記載の調製物。

【請求項4】 調製物がUVフィルター物質として、非対称性に置換されたs-トリアジン誘導体、なかでも2,4-ビス-[4-(2-エチルヘキシルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル]-6-(4-メトキシフェニル)-1,3,5-トリアジン及び/又はジオクチルブチルアミドトリアゾンを含んでなることを特徴とする、請求項1記載の調製物。

【請求項5】 調製物が、フェニレン-1,4-ビス-(2-ベンズイミダジル)-3,3'-5,5'-テトラスルホン酸及びその塩、ベンゼン-1,4-ジ(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル-10-スルホン酸)及びその塩、2-フェニルベンズイミダゾール-5-アースルホン酸及びその塩、並びに3-ベンジリデンカンファーノスルホン酸誘導体及びそれらの塩からなる群から選択されるスルホン化UVフィルターを含んでなることを特徴とする、請求項1記載の調製物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、水中油型の低粘性の化粧品及び皮膚科学的調製物、なかでも2000mPa·s未満の粘性をもつ噴霧可能なO/Wエマルション、並びに化粧品及び医薬品の目的のためのそれらの使用法に関する。

【0002】

【従来の技術】 化粧品調製物は本質的には皮膚の手入れのために使用される。ヒトの皮膚は人間の最大の器官であり、多數の生命機能を実施する。それは成人において約2m²の平均面積を有するので、保護的及び感覚的器官として重要な役割を有する。その多數の機能(例えば熱の調節のための)のなかでも、皮膚(及び従って最終的には生体全体)を乾燥から保護するバリヤー機能が、これまでの所、最も重要である。同時に、皮膚は外界物質(例えば汚れ、化合物、微生物)の侵入及び吸収に対

する保護装置として働く。更にそれは、ヒトの代謝における調節及び標的器官として重要な役割を有する。

【0003】 化粧品の皮膚の手入れの主目的は、環境の影響に対するそして内因性物質(水のみならずまた、生來の脂肪、電解質等)の喪失に対するバリヤーとしての皮膚の生來の機能を強化又は再生することである。

【0004】 皮膚の手入れのもう一つの目的は、日常の洗浄によりもたらされる脂質及び水分の、皮膚による喪失を補うことである。これは特に、生來の再生能が不適切な場合に重要である。更に、皮膚手入れ用製品は環境の影響、なかでも日光及び風から保護し、皮膚の老化を遅らせなければならない。

【0005】 皮膚に対する太陽光線の紫外線部分の有害作用は一般に知られている。それらのそれぞれの波長に応じて、光線は皮膚器官に異なる作用を有する、すなわち290nm未満の波長をもつUV-C光線は地球の大気層中のオゾン層により吸収され、生理学的には重要でない。それに対し、290nmと320nmの間の範囲の光線、UV-A域は紅斑、軽い日焼け又は様々な重症度の熱傷すらを引き起す。UV-A光線(320ないし400nm)は、皮膚における光線力学的、具体的には光線毒性反応及び慢性の変化の引金を引くことに関して、UV-B光線よりずっと有害である。例えば、UV-A光線はそれ自体で、極めて普通の日常の条件下で、短時間にコラーゲン及びエラスチン繊維を損傷するのに十分である。UV-B光線の有害作用はまたUV-A光線により更に増強される可能性もある。

【0006】 更に、非常に低い光線量ですら、光線化学反応の引金になる可能性がある。これらはなかでも、フリーラジカルの形成を含み、それらの高度な反応性の結果として、それが順次、制御されない二次的反応の引金になり得る。このような反応を防止するために、UVフィルター物質のみならず、更に化粧品又は皮膚科学的調製物に抗酸化剤及び/又はフリーラジカルスカベンジャーを添加することもできる。

【0007】 医薬品の局所用組成物は一般的に、有効濃度の1種類以上の医薬品を含んでなる。簡略化のため、化粧品及び医薬品の使用及び対応する製品の間を明確に区別するために、ドイツ連邦共和国の法令(例えば化粧品指針、食糧及び薬剤条例)が参照されている。

【0008】 これまでのところ、皮膚手入れ用組成物の分野において最も重要な型の製品はエマルションである。エマルションは乳化剤を使用して相互に非常に微細な液滴の形態で分散されている、少なくとも1種類の脂肪相(脂肪及び鉱油、脂肪酸エステル、脂肪アルコール等)及び、少なくとも1種類の水相(水、グリセロール、グリコール等)からなる、分散された2-又は多相系の化粧品エマルションである。油相が水相中に微細に分配されている場合はこれは水中油エマルション(O/Wエマルション、例えば牛乳)である。O/Wエマル

ションの基本的特徴は水により決定され、すなわちそれは皮膚上で脂ぎった感じがより少なく、むしろ艶消し状態で、W/Oエマルションよりも皮膚中により早急に吸収される。

【0009】当業者はもちろん、化粧品又は皮膚科学的用途のために安定なO/W調製物、例えば、室温から皮膚温の範囲内で塗布することができるクリーム及び軟膏の形態で、又は、この温度範囲ではより流動性のローション及び乳剤として調製する多数の選択肢を知っている。

【0010】エマルションの安定性はなかでも、それらの粘性、特に外部相の粘性に依存する。エマルションは、微細分散粒子が再度集合して相対的に大きい凝集物(aggregate)を形成し、接触している液滴が融合(coalesce)する時に不安定になる。この過程は凝集と呼ばれる。エマルションの外部相がより粘性であるほど、凝集の経過は遅くなる。

【0011】従って、O/Wエマルションは通常、水相の粘性を増加させる増粘剤により安定化される。この目的に適した例はポリアクリレート(カーボマー)及び更なる有機増粘剤である。安定性を改善するこの方法の欠点は、電解質に対するこれらの調製物の感受性である。更に、主としてより高粘性の調製物(クリーム又は軟膏のような)はもちろん、この方法で調製することができる。

【0012】「液体」の(=流動性の)コンステンシーのエマルションは化粧品中に、例えば、手入れ用ローション、クレンジングローション、顔面ローション又はハンドローションとして使用される。それらは概略的に約2000mPa·sないし約10,000mPa·sの粘性をもつ。粒子の著しく大きい移動度がより早急な融合を促進するので、流動性エマルションの安定性は特に注目に値する。

【0013】従来技術の液体エマルションですら—それらもまた一般的に増粘剤を含んでるので—それ自体相分離として現れる、比較的高い電解質濃度に対する安定ではない。しかし、しばしば、その、他の物理的、化学的又は生理学的特性を利用することができるためには、例えば、水溶性のUVフィルターのようなある種の電解質を使用することが所望される。多くの場合、乳化剤系の適切な選択がある程度の是正策を提供することができるが、その場合にはその他の不都合も同様にしばしば発生する。

【0014】前記の不都合は、例えば、通常の化粧品乳化剤の使用はもちろん概略的には全く危険性はないが、最終的にはあらゆる化学物質と同様に、乳化剤は個々の事例においてアレルギー反応又は使用者の過敏性に基づく反応の引金をひく可能性があるという事実にある可能性がある。

【0015】光線保護調製物として使用することを意図

されている化粧品及び皮膚科学的調製物に対しては特に、UV-吸収物質と並んで、理想的な場合には、皮膚上に、入射するUV光線を反射する光線不透過性の層を形成するUVフィルター物質として、疎水性無機微細顔料を取り入れることもまた望ましい。

【0016】しかし、従来技術は実際的には、その中に疎水性無機微細顔料を取り入れることができた低粘性(スパイラル)調製物を認めない。

【0017】欧州特許第667 144号明細書は、水中油エマルションであり、光保護剤として金属酸化物を基礎にした無機ナノ顔料を含んでなる化粧品日焼け止め組成物につき記載しており、その調製物は噴霧性であることも可能であるが、この明細書は本発明への道程を指摘することができなかった。

【0018】概略的に、従来技術の低粘性調製物はしばしば、狭い応用範囲又は原料物質の非常に制約された選択に制約されるという不都合を有する。比較的高濃度の極性の油成分の取り入れはまたしばしば、問題を提起する。しかし、幾つかの場合には、例えば、高い日光保護因子を達成することができるためには、調製物中に大量の極性の油成分を取り入れることが所望される。

【0019】従って、市販可能製品に要求される貯蔵安定性をもつ低粘性をもつエマルションは前記の事項を考慮すると、仮に存在するとしても、著しい努力を伴って調製することができるだけである。従って、このような調製物の供給量は極めて低い。しかし、このような調製物は消費者に、これまで知られていない化粧品的結果を提供する可能性があるであろう。

【0020】

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は非常に低い粘性をもち、従来技術の不都合をもたない水中油型の調製物を調製することであった。本発明の更なる目的は、増加された電解質濃度に対して安定で、その中に大量の極性油成分を取り入れができる、できるだけ低粘性の、化粧品又は皮膚科学的O/Wエマルションを調製する方法を見出すことであった。

【0021】

【発明を解決するための手段】驚くべきことには、これらの目的は、

1. その中に疎水性無機微細顔料が取り入れられた油相、
2. 水相及び
3. a) 少なくとも1種類の増粘剤及び
b) 最大で0.5重量%の1種類以上の乳化剤の組み合わせ物、を含んでなり、そして所望の場合には、通常の化粧品又は皮膚科学的助剤、添加剤及び/又は活性成分を含んでなる、水中油型の、低粘性の化粧品又は皮膚科学的調製物により達成される。

【0022】本発明に従う調製物が従来技術の調製物よりも、

- 調製がより容易であり、
- 油及び水相の崩壊に対してより高い安定性をもち、そして
- 例えば皮膚上の塗布性又は皮膚中への吸収性のようなど、より良い感覚特性をもつであろう、ことは当業者により予測できなかった。

【0023】比較的大量の極性油成分ですら何の問題もなく本発明に従う調製物中に取り入れられることができ、その結果、例えば高い日光保護因子をもつ噴霧性調製物が今や容易に入手可能であることは特に驚くべきことであった。

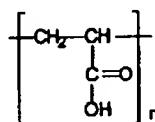
【0024】従って、本発明に従う調製物は低粘性O/Wエマルションに関する従来の当該技術を高めたものである。

増粘剤

本発明に従って好都合な増粘剤は、アクリル酸のポリマー、なかでも、カーボマー又はカーボボール (Carbopol^(R)は実際にはB. F. Goodrich Companyの登録商標である) の群から選択されるものである。カーボボールはその分子量が約400,000と約4,000,000以上の間の可能性がある、一般構造式

【0025】

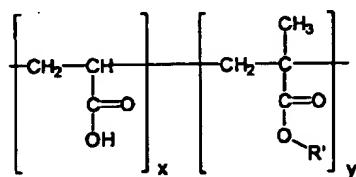
【化1】



【0026】の化合物である。カーボボールの群はまた、アクリレート-アクリル酸アルキルコポリマー、例えば次の構造

【0027】

【化2】



【0028】[式中、R'は長鎖のアルキル基であり、そしてx及びyはそれぞれのコモノマーのそれぞれの計算量を表す数である]を特徴としてもつものをも含む。これらのカーボボールもまた、本発明の目的に好都合である。

【0029】好都合なカーボボールの例は、等級907、910、934、940、941、951、954、980、981、1342、1382、2984及び5984であり、これらの化合物は個別に存在しても相互に組み合わせても存在することができる。カーボボール981（個別にも又はその他の増粘剤と組み合わせ

ても）が特に好ましい。

【0030】アクリレート/アクリル酸アルキルコポリマーに比較して、アクリル酸C_{10~30}-アルキルと、アクリル酸、メタクリル酸又はそれらのエステルの1種類以上のモノマーとのコポリマーもまた、本発明の目的に好都合である。これらの化合物のINCI名称は“Acrylates/C_{10~30} Alkyl Acrylate Crosspolymer”（「アクリレート/アクリル酸C_{10~30}アルキルクロスポリマー」）である。B. F. Goodrich Companyから商品名Pemulen TR1及びPemulen TR2として市販されているものが特に好都合である。

【0031】一般にトウモロコシの糖から発酵により生成され、カリウム塩として単離されるアニオンのヘテロ多糖である、キサンタンゴムとも呼ばれるキサンタン（CAS No. 11138-66-2）もまた本発明の目的に好ましい。それは好気性条件下で、 2×10^6 ないし 24×10^6 の分子量をもち、キサントモナス・カンペストリス (Xanthomonas campestris) 及び幾つかのその他の種により生成される。キサンタンは側鎖をもつβ-1, 4-結合グルコース（セルロース）をもつ鎖から形成されている。サブグループ（「繰り返し単位」）の構造はグルコース、マンノース、グルクロン酸、アセテート及びビルベートからなる。

【0032】ある活性成分の溶解度を改善するか又はそれらの安定性を増加させるためには、化粧品又は皮膚科学的調製物のpHをある値に調整することが通常であり、その場合には、この目的のための組成物を緩衝することが好都合の可能性がある。

【0033】従って例えば、あるUVフィルター物質における溶解度を増加させるためには、例えば、本発明に従う化粧品又は皮膚科学的調製物を、実質的に中性のpHに調整することが好ましい可能性がある。この場合、本発明の目的のためには、アクリル酸C_{10~30}-アルキル/アクリレートコポリマーの群から、なかでもPemulen TR1及びPemulen TR2からなる群から増粘剤もしくは増粘剤類を選択することが好ましい。

【0034】他方、本発明に従う化粧品又は皮膚科学的調製物のpHが僅かに酸性であり、すなわち、約4ないし約5の範囲内にある場合には、カーボボールの群、なかでもカーボボール981から増粘剤を選択することが本発明に従って好ましい。僅かに酸性の調製物のためのもう1種類の好ましい増粘剤はキサンタンゴムである。

【0035】完成化粧品又は皮膚科学的O/Wエマルション中の1種類以上の増粘剤の総量は好都合には、調製物の総重量の1重量%未満、好ましくは0.05と0.6重量%の間に選択される。

乳化剤

乳化剤の特徴となる点は親水性及び親油性の分子部分である。一つの部分が優勢であるか又は2種類の部分は平衡しているかが、異なる特性又は異なる型のエマルションすらがもたらされるか否かを決定する。

【0036】様々な乳化剤を親水性／親油性比に従って分類する一つの補助手段はHLB値、Hydrophilic Lipophilic Balance（親水性親油性平衡）である。HLB値は乳化剤の水-又は油-溶解度の指標である。これに従うと、各乳化剤に対し、1ないし20の目盛りで乳化剤を分類し、それらの適用性に関してそれらを説明する数値を計算又は測定できる。<10のHLB値をもつ乳化剤は親油性と呼ばれ、それより高い(>10) HLB値をもつものは親水性と呼ばれる。

【0037】親水性乳化剤は本発明の目的に対して好都合である。リン酸トリセテアレス-4、リン酸トリラウレス-4、リン酸トリオレス-8、リン酸セチル、リン酸ステアリル、硫酸セテアリルからなる群から選択される親水性乳化剤が好ましい。

【0038】乳化剤もしくは乳化剤類はまた、好ましくは、通常のアルカリ（例えば、水酸化ナトリウム及びカリウム、炭酸ナトリウム及びカリウム、並びにモノ及びトリエタノールアミンのよう）により部分的に又は完全に中和された脂肪酸の群から選択される。

【0039】特に好都合な例は、ステアリン酸及びステアレート、イソステアリン酸及びイソステアレート、パルミチン酸及びパルミテート、並びにミリスチン酸及びミリステートである。

【0040】リン酸トリラウレス-4が、本発明の目的に特に好ましい。リン酸トリラウレス-4はポリエチレン(200)ラウリルエーテルとリン酸のトリエステルであり、例えば、Clariantから商品名Hostaphat KL 340Dとして市販されている。

【0041】本発明に従うと、完成化粧品又は皮膚科学的O/Wエマルション中の1種類以上の乳化剤の総量は、調製物の総重量の1重量%未満、好ましくは0.1と0.6重量%の間に選択される。

【0042】1種類以上の増粘剤及び1種類以上の乳化剤を合わせた総量が2重量%未満に、なかでも0.5と1.5重量%の間に選択される場合に特に好都合である。

油相

本発明に従うO/Wエマルションの油相は好都合には、極性の油の群、例えばレシチン及び脂肪酸トリグリセリド、すなわち、3ないし24個の炭素原子、なかでも12ないし18個の炭素原子の鎖長をもつ、飽和及び/又は不飽和の分枝及び/又は非分枝アルカンカルボン酸のトリグリセロールエステルの群から選択される。脂肪酸トリグリセリドは例えば、オリーブ油、ヒマワリ油、大豆油、落花生油、菜種油、アーモンド油、ヤシ油、ココ

ナツ油、ヒマシ油、小麦胚芽油、フドウの種油、アザミ油、ツキミソウ油、マカダミアナッツ油等のような合成、半合成及び天然油の群から選択することができる。

【0043】本発明の目的のために更に好都合な極性の油成分はまた、3ないし30個の炭素原子の鎖長をもつ飽和及び/又は不飽和の、分枝及び/又は非分枝アルカンカルボン酸の、3ないし30個の炭素原子の鎖長をもつ飽和及び/又は不飽和の、分枝及び/又は非分枝アルコールとのエステルの群から選択される。その場合、このようなエステル油は好都合には、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸イソプロピル、ステアリン酸n-ブチル、ラウリン酸n-ヘキシル、オレイン酸n-デシル、ステアリン酸イソオクチル、ステアリン酸イソノニル、イソノナン酸イソノニル、パルミチン酸2-エチルヘキシル、ラウリン酸2-エチルヘキシル、ステアリン酸2-ヘキシルデシル、パルミチン酸2-オクチルドデシル、オレイン酸オレイル、エルカ酸オレイル、オレイン酸エルシル、エルカ酸エルシル及び、例えばホホバ油のようなこれらのエステルの合成、半合成及び天然の混合物からなる群から選択することができる。

【0044】更に、油相は好都合には、ジアルキルエーテルの群、飽和又は不飽和の、分枝又は非分枝アルコールの群から選択することができる。本発明に従うO/Wエマルションの油相が安息香酸C_{12~15}-アルキルを含むか、又はこれのみからなる場合に特に好都合である。

【0045】更に、本発明に従うO/Wエマルションの油相は同様に、好都合にまた、非極性油、例えば分枝及び非分枝炭化水素及び炭化水素ワックス、なかでもワセリン（ペトロラタム）、パラフィン油、スクアラン及びスクアレン、ポリオレフィン及び水素化ポリイソブテンの群から選択されたものを含んでなる可能性がある。ポリオレフィンのなかではポリデセンが好ましい物質である。

【0046】シリコーン油もしくはシリコーン油類とは別に、その他の油相成分を付加的に含むことが好ましいが、油相はまた、好都合には、環式又は線状シリコーン油を含むかあるいは、これらの油のみからなることができる。

【0047】シクロメチコン（オクタメチルシクロテトラシロキサン）は好都合には、本発明に従って使用することができるシリコーン油として使用される。しかし、その他のシリコーン油、例えばヘキサメチルシクロトリシロキサン、ポリジメチルシロキサン、ポリ（メチルフェニルシロキサン）もまた本発明の目的のために好都合に使用することができる。

【0048】本発明に従う化粧品及び皮膚科学的調製物

はまた、UV光線に対して皮膚を保護するために化粧品中に通常使用される疎水性無機微細顔料を含んでなる。これらはチタン、亜鉛、鉄、ジルコニウム、ケイ素、マンガン、アルミニウム、セリウムの酸化物及びそれらの混合物並びに、酸化物がその中で活性剤であるような誘導体である。二酸化チタンに基づいた顔料が特に好ましい。

【0049】疎水性無機微細顔料は水を撓くように表面処理することができる。この表面処理は、それら自体は既知の方法で顔料に薄い疎水性の層を提供することを伴う可能性がある。好都合な疎水性のTiO₂顔料は例えば、Degussa社から商品名T 805として(CAS No. 100209-12-9, ex 1346 3-67-7)入手できる。

【0050】油中の超微細二酸化チタンの分散物又は油性の二酸化チタン懸濁物、例えばカプリル酸/カプリン酸トリグリセリド中の二酸化チタン、主としてカプリル酸[CH₃(CH₂)₆COOH]及びカプリン酸[CH₃(CH₂)₈COOH]のトリグリセリドの混合物もまた本発明に従って好都合である。例えばSolaveil社から商品名Ti ove i l TGとして市販の油性の二酸化チタン懸濁物が好ましい。

【0051】疎水性無機微細顔料は調製物の油相中に取り入れられる。

化粧品又は皮膚科学的補助剤及び添加剤

本発明に従う調製物の水相は場合によっては、好都合には、低炭素数のアルコール、ジオール又はポリオール及びそれらのエーテル、好ましくはエタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、エチレングリコールモノエチルもしくはモノブチルエーテル、プロピレングリコールモノメチル、モノエチルもしくはモノブチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルもしくはモノエチルエーテル及び類似製品、並びに更に、低炭素数のアルコール、例えばエタノール、イソプロパノール、1, 2-プロパンジオール、グリセロールを含んでなる。

【0052】特に好都合な調製物はまた、抗酸化剤を添加剤又は活性成分として使用する時に得られる。本発明に従う調製物は好都合には、1種類以上の抗酸化剤を含んでなる。使用される、好ましいがしかし場合によって使用される抗酸化剤は、化粧品及び/又は皮膚科学的適用に適した又はそれに通常のすべての抗酸化剤である。

【0053】抗酸化剤は好都合には、非常に少量の許容投与量(例えばpmolからμmol/kg)における、アミノ酸(例えばグリシン、ヒスチジン、チロシン、トリプトファン)及びそれらの誘導体、イミダゾール(例えばウロカニン酸)及びそれらの誘導体、D, L-カルノシン、D-カルノシン、L-カルノシン及びそれらの誘導体(例えばアンセリン)のようなペプチド、カロテノイド、カロテン(例えばα-カロテン、β-カ

ロテン、リコペン)及びそれらの誘導体、リボ酸及びその誘導体(例えばジヒドロリボ酸)、アウロチオグルコース、プロビルチオウラシル及びその他のチオール(例えばチオレドキシン、グルタチオン、システイン、シスチン、システミン並びに、それらのグリコシル、N-アセチル、メチル、エチル、プロピル、アミル、ブチル及びラウリル、パルミトイyl、オレイル、アーリノレイル、コレステリル及びグリセリルエステル)及びそれらの塩、チオジプロピオン酸ジラウリル、チオジプロピオン酸ジステアリル、チオジプロピオン酸及びその誘導体(エステル、エーテル、ペプチド、脂質、ヌクレオチド、ヌクレオシド及び塩)及びスルホキシミン化合物(例えばブチオニン・スルホキシミン、ホモシティン・スルホキシミン、ブチオニン・スルホン、ペントー、ヘキサー、ヘプタチオニン・スルホキシミン)、並びに更に(金属)キレート化剤(例えばα-ヒドロキシ脂肪酸、パルミチン酸、フィチン酸、ラクトフェリン)、α-ヒドロキシ酸(例えばクエン酸、乳酸、リンゴ酸)、フミン酸、胆汁酸、胆汁抽出物、ビリルビン、ビリペルシン、EDTA、EGTA及びそれらの誘導体、不飽和脂肪酸及びそれらの誘導体(例えばアーリノレン酸、リノール酸、オレイン酸)、葉酸及びその誘導体、ユビキノン及びユビキノール及びそれらの誘導体、ビタミンC及び誘導体(例えばパルミチン酸アスクルビル、リン酸アスクルビルMg、酢酸アスクルビル)、トコフェロール及び誘導体(例えば酢酸ビタミンE)、ビタミンA及び誘導体(パルミチン酸ビタミンA,)及びベンゾイン樹脂の安息香酸コニフェリル、ルチン酸及びその誘導体、フェルラ酸及びその誘導体、ブチル化ヒドロキシトルエン、ブチル化ヒドロキシアニソール、ノルジヒドログアヤク酸、ノルジヒドログアヤレチン酸、トリヒドロキシブチロフェノン、尿酸及びその誘導体、マントース及びその誘導体、亜鉛及びその誘導体(例えばZnO, ZnSO₄)、セレン及びその誘導体(例えばセレノメチオニン)、スチルベン及びそれらの誘導体(例えば酸化スチルベン、酸化トランヌースチルベン)、並びに、本発明に従って適した前記の活性成分の誘導体(塩、エステル、エーテル、糖、ヌクレオチド、ヌクレオシド、ペプチド及び脂質)からなる群から選ばれる。

【0054】本発明の目的のためには油溶性抗酸化剤の使用が特に好都合である。

【0055】本発明の驚くべき特性は、本発明に従う調製物が皮膚中への化粧品又は皮膚科学的活性成分の良好なビヒクルであり、好ましい活性成分が、酸化的ストレスから皮膚を保護することができる抗酸化剤であることである。これに関して好ましい抗酸化剤はビタミンE及びその誘導体、並びにビタミンA及びその誘導体である。

【0056】調製物中の抗酸化剤(1種類以上の化合

物)の量は好ましくは、調製物の総重量の0.001ないし30重量%、特に好ましくは0.05ないし20重量%、なかでも0.1ないし10重量%である。

【0057】ビタミンE及び/又はその誘導体が抗酸化剤(類)である場合には、それらのそれぞれの濃度を、調製物の総重量の0.001ないし10重量%の範囲から選択することが好都合である。

【0058】ビタミンA又はビタミンA誘導体、あるいはカロテン又はそれらの誘導体が抗酸化剤(類)である場合には、それらのそれぞれの濃度を、調製物の総重量の0.001ないし10重量%の範囲から選択することが好都合である。

【0059】当業者はもちろん、化粧品調製物は大部分の場合、通常の補助剤及び添加剤なしでは考えられないことを知っている。従って、本発明に従う化粧品及び皮膚科学的調製物はまた、これらの調製物中に通常使用されるような化粧品補助剤、例えば、増粘剤、安定剤、充填剤、保存剤、香料、消泡剤、染料、着色効果をもつ顔料、その他の界面活性物質、皮膚軟化剤、加湿剤及び/又は保湿剤、抗炎症物質、ビタミン又は蛋白質のような付加的活性成分、光保護剤、忌虫剤、殺バクテリヤ剤、殺ウィルス剤、水、塩、抗微生物剤、蛋白分解もしくは角質溶解物質、医薬品あるいは、アルコール、ポリオール、ポリマー、気泡安定剤、有機溶媒又は更に電解質のよう、化粧品又は皮膚科学的調製物のその他の通常の成分、を含んでなることができる。

【0060】医薬品調製物の調製に対しては、対応する要請事項を必要な変更を加えて適用する。

【0061】本発明に従うO/Wエマルションは、化粧品及び皮膚科学的調製物のための基剤として使用することができる。後者は通常の組成を有し、例えば皮膚及び/又は毛髪の処置及び手入れのために、口唇の手入れ製品として、消臭製品として、そして装飾化粧品におけるマークアップ製品又はマークアップ落とし製品として、又は日光保護調製物として使用することができる。使用のためには、本発明に従う化粧品及び皮膚科学的調製物は化粧品又は皮膚科学的組成物として通常の方法で十分量を皮膚及び/又は毛髪に適用される。

【0062】従って、本発明の目的のための化粧品又は局所用皮膚科学的組成物は、それらの組成に応じて、例えば、皮膚の保護クリーム、クレンジング乳液、日焼け止め剤等として使用することができる。幾つかの状況においては、本発明に従う組成物を製薬学的調製物のための基剤として使用することができ、好都合である。

【0063】本発明に従う低粘性の化粧品又は皮膚科学的組成物は例えば、エアゾール容器、しづり出し可能なビンから、又はポンプ装置により噴霧することができる調製物の形態、あるいは、ロールオン装置により適用することができる液体組成物の形態、しかしまだ標準のビン及び容器から適用することができるエマルションの形

態にすることができる。

【0064】本発明の目的のための、エアゾール容器から噴霧することができる化粧品又は皮膚科学的調製物に適した噴射剤は、単独で又は相互の混合物として使用することができる、通常知られた容易に揮発性の、液化噴射剤、例えば炭化水素(プロパン、ブタン、イソブタン)である。圧縮空気もまた好都合に使用される。

【0065】当業者にはもちろん、それら自体は無毒性で、原則的にはエアゾール調製物の形態で本発明の実現に適するであろうが環境又はその他の付随する環境へのそれらの有害な影響のために回避されなければならない噴射剤、なかでもフッ化炭化水素及びクロロフルオロ炭素(CFC)が存在することは知られている。

【0066】日焼け止め剤の形態の化粧品及び皮膚科学的調製物もま好ましい。これらは好ましくは更に、本発明に従う活性成分組み合わせ物に加えて、少なくとも1種類のUV-Aフィルター物質及び/又は少なくとも1種類のUV-Bフィルター物質を含んでなる。

【0067】しかし本発明の目的のためには、それらの主要な目的が日光からの保護ではないがUV保護剤を含む化粧品及び皮膚科学的調製物を提供することも好都合である。従って例えば、UV-A又はUV-Bフィルター物質は通常、デイクリーム中に取り入れられている。

【0068】UV保護剤はまた、抗酸化剤及び、所望の場合には保存剤のように調製物自体を損傷から有効に保護する。

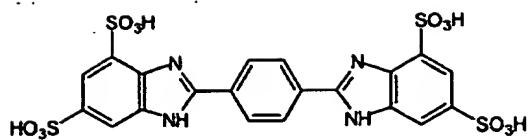
【0069】本発明に従う調製物は好都合には、UV-A及びUV-B域のUV光線を吸収する物質を含んでなり、フィルター物質の総量は、紫外線全域から毛髪及び皮膚を保護する化粧品調製物を提供するためには、例えば、調製物の総重量の0.1重量%ないし30重量%、好ましくは0.5ないし20重量%、特には1.0ないし15重量%である。それらはまた毛髪又は皮膚のための日焼け止め剤としても使用することができる。

【0070】本発明の目的のために好都合なUV-Aフィルター物質はジベンゾイルメタン誘導体、なかでも、商品名Parson^(R)1789としてGivaudan社により、そして商品名Eusolex^(R)9020としてMerck社により販売されている、4-(tert-ブチル)-4'-メトキシジベンゾイルメタン(CAS No. 70356-09-1)である。

【0071】更に好都合なUV-Aフィルター物質はフェニレン-1,4-ビス(2-ベンズイミダジル)-3,3'-5,5'-テトラスルホン酸、

【0072】

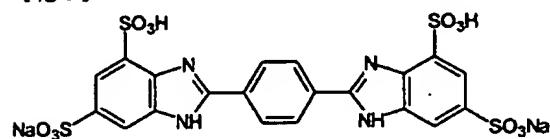
【化3】



【0073】及びその塩、特に対応するナトリウム、カリウム又はトリエタノールアンモニウム塩、なかでもフェニレン-1, 4-ビス-(2-ベンズイミダジル)-3, 3'-5, 5'-テトラスルホン酸ビス-ナトリウム塩、

【0074】

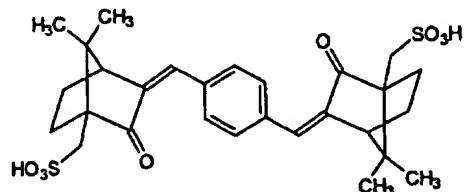
【化4】



【0075】及び、ベンゼン-1, 4-ジ(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル-10-スルホン酸)とも呼ばれ、次の構造

【0076】

【化5】



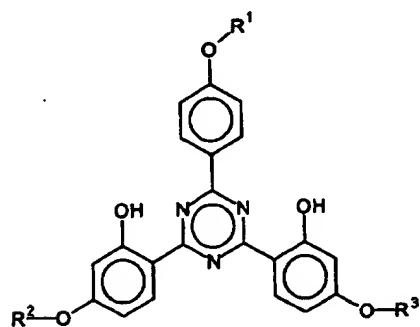
【0077】を特徴としてもつ、1, 4-ジ(2-オキソ-10-スルホ-3-ボルニリデンメチル)ベンゼン及びその塩（なかでも対応する10-スルファト化合物、なかでも対応するナトリウム、カリウム又はトリエタノールアンモニウム塩）、である。

【0078】本発明の目的に好都合なUVフィルター物質はまた、広域フィルター、すなわちUV-A及びまたUV-B光線の両方を吸収するフィルター物質である。

【0079】好都合な広域フィルター及び/又はUV-Bフィルター物質は例えば、次の構造

【0080】

【化6】

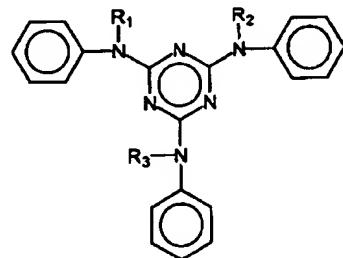


【0081】【式中、R¹、R²及びR³は相互に独立して、1ないし10個の炭素原子をもつ分枝及び非分枝アルキル基の群から選択されるかあるいは、単一の水素原子である】をもつビスレソルシニルトリアジン誘導体である。C IBA-Chemikalien GmbHから商品名Tinosorb^(R)Sとして販売されている、2, 4-ビス{[4-(2-エチルヘキシルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル}-6-(4-メトキシフェニル)-1, 3, 5-トリアジン(INCI: Aniso Triazine)並びに、商品名UVINUL^(R)T150としてBASF Aktiengesellschaftにより販売されている、4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイソトリアミノ)トリス安息香酸トリス(2-エチルヘキシル)、同義語: 2, 4, 6-トリス[アニリノ-(p-カルボ-2'-エチル-1'-ヘキシルオキシ)]-1, 3, 5-トリアジン(INCI: Octyl Triazone)が特に好ましい。

【0082】構造式

【0083】

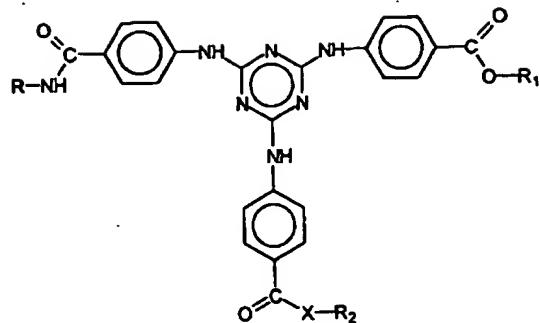
【化7】



【0084】をもつその他のUVフィルター物質、例えば、その化学構造が一般式

【0085】

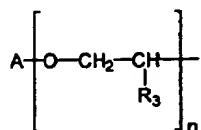
【化8】



【0086】[式中、Rは、場合により1個以上のC₁～C₄-アルキル基で置換された分枝又は非分枝C₁～C₁₈-アルキル基、C₅～C₁₂-シクロアルキル基であり、Xは酸素原子又はNH基であり、R₁は、場合により1個以上のC₁～C₄-アルキル基、又は水素原子、アルカリ金属原子、アンモニウム基又は式

【0087】

【化9】

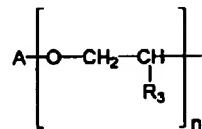


【0088】(ここで、Aは、場合により1個以上のC₁～C₄-アルキル基により置換された分枝又は非分枝C₁～C₁₈-アルキル基、C₅～C₁₂-シクロアルキル又はアリール基であり、R₃は水素原子又はメチル基であり、nは1ないし10の数である)の基により置換された分枝又は非分枝C₁～C₁₈-アルキル基、C₅～C₁₂-シクロアルキル基であり、R₂は、XがNH基である時には、場合により1個以上のC₁～C₄-アルキル基により置換された分枝又は非分枝C₁～C₁₈-アルキル基、C₅～C₁₂-シクロアルキル基であり、そしてXが酸素原子である時には、場合により1個以上のC₁～C₄-ア

ルキル基、又は水素原子、アルカリ金属原子、アンモニウム基又は式

【0089】

【化10】

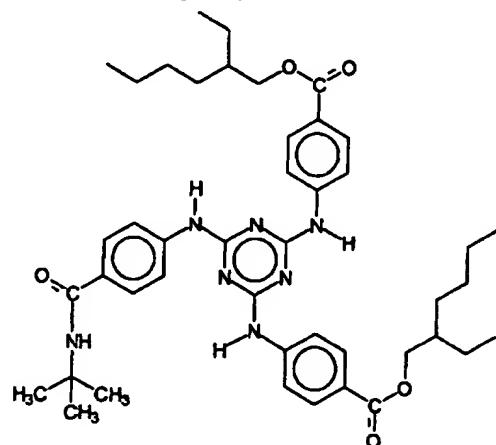


【0090】(ここで、Aは、場合により1個以上のC₁～C₄-アルキル基により置換された分枝又は非分枝C₁～C₁₈-アルキル基、C₅～C₁₂-シクロアルキル基、アリール基であり、R₃は水素原子又はメチル基であり、nは1ないし10の数である)の基により置換された分枝又は非分枝C₁～C₁₈-アルキル基、C₅～C₁₂-シクロアルキル基、アリール基であり、XがNH基である]により表される、歐州特許出願公開第570 838号明細書に記載のs-トリアジン誘導体、もまた本発明の目的に好都合なUVフィルター物質である。

【0091】本発明の目的に特に好ましいUVフィルター物質はまた、非対称に置換されたs-トリアジンであり、その化学構造は式

【0092】

【化11】



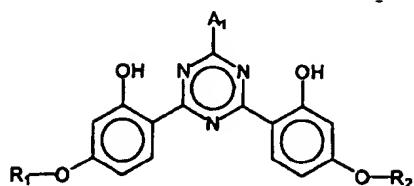
【0093】により表され、下記でジオクチルブチルアミドトリアゾンとも呼ばれる。

【0094】歐州特許出願公開第775 698号明細書はまた、好ましいビスレソルシニルトリアジン誘導体

につき記載し、その化学構造は一般式

(0095)

〔化12〕



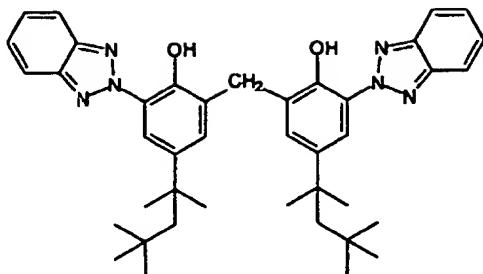
【0096】[式中、 R_1 、 R_2 及び A_1 は非常に異なる有機基を表す]により表される。

【0097】2, 4-ビス { [4-(3-スルホナト)-2-ヒドロキシプロピルオキシ]-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-(4-メトキシフェニル)-1, 3, 5-トリアジンナトリウム塩、2, 4-ビス { [4-(3-(2-プロピルオキシ)-2-ヒドロキシプロピルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-(4-メトキシフェニル)-1, 3, 5-トリアジン、2, 4-ビス { [4-(2-エチルヘキシルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-[4-(2-メトキシエチルカルボキシル)フェニルアミノ]-1, 3, 5-トリアジン、2, 4-ビス { [4-(3-(2-プロピルオキシ)-2-ヒドロキシプロピルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-[4-(2-エチルカルボキシル)フェニルアミノ]-1, 3, 5-トリアジン、2, 4-ビス { [4-(2-エチルヘキシルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-(1-メチルピロール-2-イル)-1, 3, 5-トリアジン、2, 4-ビス { [4-トリス(トリメチルシリル)プロピルオキシ]-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-(4-メトキシフェニル)-1, 3, 5-トリアジン、2, 4-ビス { [4-(2"-メチルプロペニルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-(4-メトキシフェニル)-1, 3, 5-トリアジン及び2, 4-ビス { [4-(1', 1', 1', 3', 5', 5', 5'-ヘプタメチルシリキシ-2"-メチルプロピルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル } -6-(4-メトキシフェニル)-1, 3, 5-トリアジンもまた本発明の目的に好都合である。

【0098】本発明の目的に好都合な広域フィルターは
2, 2' -メチレンビス(6-(2H-ベンゾトリアゾ
ール-2-イル)-4-(1, 1, 3, 3-テトラメチ
ルブチル)フェノール)であり、化学構造式

(0099)

〔化13〕

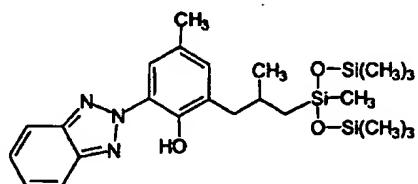


【0100】を特徴としてもち、CIBA-Chemie
kalien GmbHから商品名Tinosorb
(R)Mとして販売されている。

【0101】本発明の目的に好都合なもう1種類の広域フィルターは、INCI名称Drometrizole Trisiloxaneをもつ、2-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル)-4-メチル-6-[2-メチル-3-[1,3,3,3-テトラメチル-1-[
[(トリメチルシリル)オキシ]ジシロキサンイル]プロピル]フェノール(CAS No.: 155633-5
4-8)であり、化学構造式

[0102]

【化 1 4】



【0103】を特徴としてもつ。

【0104】UV-Bフィルターは油溶性でも水溶性でもよい。好都合な油溶性UV-Bフィルター物質の例は

- ・ 3-ベンジリデンカンファー誘導体、好ましくは3-(4-メチルベンジリデン)カンファー、3-ベンジリデンカンファー、
 - ・ 4-アミノ安息香酸誘導体、好ましくは4-(ジメチルアミノ)安息香酸2-エチルヘキシル、4-(ジメチルアミノ)安息香酸アミル、
 - ・ 2, 4, 6-トリアニリノ(p-カルボ-2'-エチル-1'-ヘキシルオキシ)-1, 3, 5-トリアジン、
 - ・ ベンザルマロン酸のエステル、好ましくは4-メトキシベンザルマロン酸ジ(2-エチルヘキシル)、
 - ・ ケイ皮酸のエステル、好ましくは4-メトキシケイ皮酸2-エチルヘキシル、4-メトキシケイ皮酸イソペンチル、
 - ・ ベンゾフェノンの誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-ヒドロキシ-4-メトキシ-4'-メチルベンゾフェノン、2, 2'-ジヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、並びに

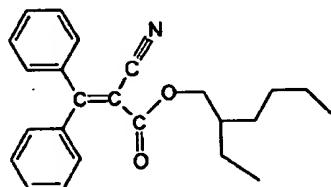
・ポリマーに結合したUVフィルター、である。
【0105】好都合な水溶性UV-Bフィルター物質の例は、

- ・2-フェニルベンズイミダゾール-5-スルホン酸の塩、例えばそのナトリウム、カリウム又はそのトリエタノールアンモニウム塩、及び更にスルホン酸自体、
- ・3-ベンジリデンカンファーのスルホン酸誘導体、例えば4-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)ベンゼンスルホン酸、2-メチル-5-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)スルホン酸及びその塩、である。

【0106】本発明に従って好都合に使用することができる更なる光線遮蔽フィルター物質は、2-シアノ-3,3-ジフェニルアクリル酸エチルヘキシル(オクトクリレン)であり、それはUvinul^(R)N 539の商品名でBASF社から販売されており、次の構造

【0107】

【化15】



	1	2	3	4	5
ステアリン酸	0.3				0.2
イソステアリン酸					0.2
リン酸トリラウレス-4		0.5	0.2	0.4	0.25
リン酸セチル	0.1		0.3		
ジメチコン		2.5		2	
フェニルトリメチコン	2		3		
カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	5	5		5	5
安息香酸C _{12~15} -アルキル		5		5	
ジカプリルエーテル		5	5		5
ジカプリル酸/カプリン酸ブチレングリコール			5		2
鉱油	4				
酢酸ビタミンE	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
ジオクチルブタミドトリアゾン	1		1		
アニソトリアジン			2	2	
メトキシケイ皮酸オクチル	1		5	8	
オクチルトリアゾン		2	1		
メチルベンジリデンカンファー	2	4	2		
ブチルメトキシジベンゾイルメタン	1	2			
二酸化チタン	2.5	1.0	2.0	1.5	3
保存剤	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
グリコール	3	6	10	6	10
キサンタンゴム			0.05	0.1	0.2
Pemulen TR1 ^(R)			0.25		
Pemulen TR2 ^(R)	0.2		0.3		
Carbopol 981 ^(R)				0.5	0.2

【0108】を特徴としてもつ。

【0109】更に、本発明に従う調製物中にポリマー結合された又はポリマーのUVフィルター物質、なかでも国際公開第92/20690号に記載のものを使用することは著しく好都合の可能性がある。

【0110】幾つかの場合には、化粧品又は皮膚科学的調製物中に、本発明に従う更なるUV-A及び/又はUV-Bフィルター、例えば、サリチル酸4-イソプロピルベンジル、サリチル酸2-エチルヘキシル(=サリチル酸オクチル)、サリチル酸ホモメンチルのような、ある種のサリチル酸誘導体を取り入れることも好都合な可能性がある。

【0111】本発明の目的のために使用することができる与えられたUVフィルターのリストはもちろん制約する意図はもたれない。

【0112】下記の実施例は本発明を制約することなく説明する役目をもつ。実施例中の数値はそれぞれの調製物の総重量に対する重量百分率である。

【0113】

【実施例】

フェニルベンズイミダゾールスルホン酸
ビスイミダジラート
所望のpHに調製するための、
水酸化ナトリウム45%溶液
水

本発明の主な特徴及び態様を以下に示す。

【0114】1. 1. その中に疎水性無機微細顔料が

取り入れられた油相、

2. 水相並びに

3. a) 少なくとも1種類の増粘剤及び

b) 最大で0.5重量%の1種類以上の乳化剤の組み合わせ物、

を含んでなる水中油型の低粘性の化粧品又は皮膚科学的調製物。

【0115】2. 更なる化粧品又は製薬学的補助剤、添加剤及び/又は活性成分が付加的に存在することを特徴とする第1項記載の調製物。

【0116】3. 本調製物の粘性が2000mPa·s未満、なかでも1500mPa·s未満(25°CにおいてHaake粘度計VT-02を使用して測定可能)であることを特徴とする、前項のうちの1項に記載の調製物。

【0117】4. それが噴霧可能であることを特徴とする、前項のうちの1項に記載の調製物。

【0118】5. 増粘剤もしくは増粘剤類が、アクリル酸のポリマー、アクリレート/アクリル酸アルキルコポリマー、アクリル酸C_{10~30}-アルキル/アクリレートコポリマー及びキサンタンゴムの群から選択されることを特徴とする、第1項記載の調製物。

【0119】6. 乳化剤もしくは乳化剤類がイオン性

1 2
2 2

全100 全100 全100 全100 全100

乳化剤の群から選択されることを特徴とする、第1項記載の調製物。

【0120】7. 乳化剤又は乳化剤類のうちの1種類がリン酸トリラウレス-4であることを特徴とする、第1項記載の調製物。

【0121】8. 化粧品又は皮膚科学的光保護剤としての第1項記載の調製物の使用。

【0122】9. 調製物がUVフィルター物質として、非対称性に置換されたs-トリアジン誘導体、なかでも2,4-ビス-[4-(2-エチルヘキシルオキシ)-2-ヒドロキシ]フェニル]-6-(4-メトキシフェニル)-1,3,5トリアジン及び/又はジオクチルブチルアミドトリアゾンを含んでなることを特徴とする、第1項記載の調製物又は第8項記載の使用。

【0123】10. 調製物が、フェニレン-1,4-ビス-(2-ベンズイミダジル)-3,3'-5,5'-テトラスルホン酸及びその塩、ベンゼン-1,4-ジ(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル-10-スルホン酸)及びその塩、2-フェニルベンズイミダゾール-5-スルホン酸及びその塩並びに、3-ベンジリデンカンファーのスルホン酸誘導体及びそれらの塩からなる群から選択されるスルホン化UVフィルターを含んでなることを特徴とする、第1項記載の調製物又は第8項記載の使用。

フロントページの続き

(51) Int.CI.⁷ 識別記号

A 61 K 7/48

47/32

47/36

F I

「コード」(参考)

A 61 K 7/48

47/32

47/36

(72) 発明者 ハインリヒ・ゲルスバルラーク
ドイツ25495クマーフエルト・キービツツ
グルント11

(72) 発明者 アリアネ・グルント
ドイツ21244ブホルツ・ティーマンスペ
ーク8

(72) 発明者 アルブレヒト・デルシュナー

ドイツ20146ハンブルク・ボムシュトラン
セ32

(72) 発明者 アンヤ・クニユツベル

ドイツ20257ハンブルク・ファベルシュト
ラーセ19